

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平5-124941

(43)公開日 平成5年(1993)5月21日

(51)Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/16		7252-4C		
7/18		7252-4C		

審査請求 未請求 請求項の数1(全 6 頁)

(21)出願番号 特願平3-318534

(22)出願日 平成3年(1991)11月6日

(71)出願人 000006769

ライオン株式会社

東京都墨田区本所1丁目3番7号

(72)発明者 森嶋 清二

神奈川県小田原市浜町1丁目6-42-305

(72)発明者 岡 美和子

神奈川県横浜市戸塚区南舞岡3-23-8

(72)発明者 山崎 洋治

神奈川県平塚市徳延440-7

(74)代理人 弁理士 小島 隆司

(54)【発明の名称】 口腔用組成物

(57)【要約】 (修正有)

【目的】 トリクロサンを配合した口腔用組成物において、アルキル硫酸塩によるトリクロサンの活性低下を防止する。

【構成】 トリクロサンとアルキル硫酸塩とを併用した口腔用組成物に水溶性スズ塩を配合する。

【効果】 トリクロサン及びアルキル硫酸塩系界面活性剤を配合した口腔用組成物に水溶性スズ塩を添加した場合、トリクロサンをアルキル硫酸塩系界面活性剤含有の口腔用組成物に安定に配合し得、トリクロサンの殺菌活性の低下が効果的に防止されて、その強力な殺菌効果が有効に発揮される。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 トリクロサンとアルキル硫酸塩とを併用した口腔用組成物に水溶性スズ塩を配合したことを特徴とする口腔用組成物。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明はトリクロサンを配合した口腔用組成物に関し、更に詳述すればトリクロサンの界面活性剤による活性低下が防止され、その殺菌作用が十分に発揮され得る口腔用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術及び発明が解決しようとする課題】従来、歯磨等の口腔用組成物に有効成分としてトリクロサンを配合するとその強力な殺菌作用により歯垢形成が抑制されることが知られており、更にトリクロサンを配合した口腔用組成物に亜鉛塩（特開昭60-239409号、同3-127719号、特公昭64-10489号）、銅化合物（特開昭62-89614号）、ポリエチレングリコール（特開昭62-126116号）などを配合することが提案されている。

【0003】しかし、トリクロサンと通常発泡剤として配合されるアルキル硫酸塩等の界面活性剤とを併用した場合、その殺菌作用が著しく低下し、その効果が十分に発揮されないという問題がある。本出願人は先に上記問題を解決するため、トリクロサン及び界面活性剤を含有する口腔用組成物にフェノール性化合物（特開平2-11511号）、水溶性カルシウム塩（特開平3-5416号）を配合することを提案したが、更に効果的な解決手段が望まれる。

【0004】なお、歯磨等の口腔用組成物には、使用したときに発泡性を与え、使用感を向上させるなどの目的から界面活性剤を配合することは必須であり、特に陰イオン界面活性剤であるアルキル硫酸塩は最もよく使用されている。従ってトリクロサンを口腔用組成物に配合する場合、その効果が界面活性剤により阻害されるということは重大な問題であり、このためトリクロサンの界面活性剤による活性低下を防止することが望まれるものである。

【0005】

【課題を解決するための手段及び作用】本発明者は上記事情に鑑み鋭意検討を重ねた結果、トリクロサン及びアルキル硫酸塩系界面活性剤を配合した口腔用組成物に水溶性スズ塩を添加した場合、トリクロサンをアルキル硫酸塩系界面活性剤含有の口腔用組成物に安定に配合し得、トリクロサンの殺菌活性の低下が効果的に防止されて、その強力な殺菌効果が有効に発揮されることを知見した。

【0006】この場合、後述する実験例から明らかなように、トリクロサンとアルキル硫酸塩とを含む口腔用組成物にピロリン酸第1スズ等の水難溶性乃至は水不溶性

スズ塩を配合してもかかる効果はなく、水溶性スズ塩を配合する場合に初めて発揮する効果である。また、トリクロサンとアルキルエーテル硫酸塩に水溶性スズ塩を配合してもトリクロサンの安定配合は達成されず、トリクロサン、アルキル硫酸塩、水溶性スズ塩の三者を併用した場合に意外にもトリクロサンが安定化するもので、これら三者の組合せがトリクロサンの安定化効果に有効であることを知見し、本発明をなすに至ったものである。

【0007】なお、トリクロサン含有の口腔用組成物にアルキル硫酸塩系界面活性剤又は水溶性スズ塩を配合することは知られている（特開昭62-89614号、特開平3-127719号等）がトリクロサン、アルキル硫酸塩系界面活性剤及び水溶性スズ塩の三者を併用すると、格別の作用効果が得られることは本発明者の新知見である。

【0008】以下、本発明につき更に詳述すると、本発明の口腔用組成物は、練歯磨、潤製歯磨等の歯磨類、マウスウォッシュ、歯肉マッサージクリーム、液状或はペースト状の局所塗布剤、トローチ、チューインガム等として使用されるもので、トリクロサンとアルキル硫酸塩系界面活性剤と水溶性スズ塩を含有してなるものである。

【0009】ここで、トリクロサンの配合量は特に制限されないが、通常口腔用組成物全体の0.001~1%（重量%、以下同じ）であり、好ましくは0.01~0.5%である。

【0010】更に、界面活性剤として用いられるアルキル硫酸塩は、炭素鎖が8~18のものが好適であり、一般的には炭素数10~14のものが好適に使用できる。アルキル硫酸塩系界面活性剤として具体的には、ラウリル硫酸ナトリウム、ミリスチル硫酸ナトリウム等が例示される。

【0011】また、水溶性スズ塩は薬学的に配合可能なものであれば無機、有機化合物のいずれの化合物でもよく、例えばフッ化第1スズ、塩化第1スズ、フッ化塩化第1スズ、酢酸第1スズ、硫酸第1スズ、酒石酸第1スズ、グルコン酸第1スズ、クエン酸第1スズ等が使用でき、中でもフッ化第1スズ、塩化第1スズ、グルコン酸第1スズが好ましく使用できる。

【0012】水溶性スズ塩の配合量は特に制限されないが、通常、組成物全体の0.01~5%、特に0.1~2%の範囲で使用することが好ましい。水溶性スズ塩の配合量が0.01%に満たないとトリクロサンの組成物中での活性低下を防止できない場合があり、5%を超えると組成物の使用感を損なう場合がある。

【0013】本発明の口腔用組成物には、上述した成分に加えて更にその目的、組成物の種類に応じて研磨剤、粘結剤、粘稠剤、発泡剤、香料成分、その他有効成分等をトリクロサンの殺菌効果を損なわない程度に配合することができる。

【0014】更に、本発明組成物はそのpHを5～6.5に調整することが好ましく、pHが上記範囲外ではトリクロサンの活性低下を十分に防止できない場合がある。

【0015】

【発明の効果】本発明の口腔用組成物は、水溶性スズ塩を配合したことにより、アルキル硫酸塩によるトリクロサンの活性低下が防止され、その強力な殺菌作用で高い歯垢形成抑制効果を発揮する。従って、本発明組成物は歯周疾患の予防に有効である。

【0016】

【実施例】以下、実験例及び実施例を示して本発明を具体的に説明するが、本発明は下記の実施例に制限されるものではない。

【0017】〔実験例〕下記に示した組成に基づき試験液を調製し、この試験液2.7mlに $1.0 \times 10^8$  CFU/mlの大腸菌浮遊液を0.3ml添加し、35℃

\*の水浴中で1分間殺菌反応を行なわせた。反応後、試験液をSCDLP培地（日本製薬（株））で希釈し、その一定量をSCDLP寒天平板（日本製薬（株））上で一晚培養し、生存菌数を求め、下記基準でその効果を評価した。結果を表1に示す。

#### 試験液組成

プロピレングリコール	4.0%
D-ソルビット	20.0
トリクロサン	0.05
界面活性剤（表1に示すもの）	0.5
スズ化合物（表1に示すもの）	0.1
PBS（10mM）	残
計	100.0%

【0018】

【表1】

No.	トリ クロ サン	界 面 活 性 剤	ス ズ 化 合 物	logCFU	pH
1	—	—	—	8.2	5.5
2	—	ラウリル硫酸 ナトリウム	—	8.0	5.5
3	○	ラウリル硫酸 ナトリウム	—	8.0	5.5
4	—	ラウリル硫酸 ナトリウム	フッ化第1スズ	8.0	5.5
5	—	ラウリル硫酸 ナトリウム	ピロリン酸 第1スズ	8.0	5.5
6	○	ラウリル硫酸 ナトリウム	フッ化第1スズ	4.6	5.5
7	○	ラウリル硫酸 ナトリウム	ピロリン酸 第1スズ	6.9	5.5
8	○	ラウリルエーテ ル硫酸Na	—	8.0	5.5
9	○	ラウリルエーテ ル硫酸Na	フッ化第1スズ	7.8	5.5

【0019】表1の結果より、トリクロサンをアルキル硫酸塩系界面活性剤と併用すると、その殺菌活性は全く認められない（No. 3）。しかし、このようなトリクロサンと界面活性剤との併用系にフッ化第1錫等の水溶性錫化合物を添加すると、トリクロサンの界面活性剤中※

※での殺菌力の低下が抑制されることがわかった（No. 6）。これらの効果は水不溶性の錫化合物（ピロリン酸第1錫）を併用した場合には認められなかった（No. 7）。

【0020】〔実施例1〕練歯磨

水酸化アルミニウム	45.0%
ゲル化性シリカ	2.0
ソルビット	25.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	1.0
ショ糖モノバルミテート	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5
サッカリンナトリウム	0.2
エタノール	0.1

(4)

特開平5-124941

5	6
安息香酸ナトリウム	0.1
ゼラチン	0.1
トリクロサン	0.3
フッ化第1スズ	0.2
フィチン酸ナトリウム	0.5
香料	1.0
水	残
計	100.0%

## 【0021】〔実施例2〕練歯磨

沈降性シリカ	25.0%
ソルビット	25.0
グリセリン	25.0
ポリビニルピロリドン	1.0
ラウロイルポリグリセリンエステル	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.0
サッカリンナトリウム	0.2
バラオキシ安息香酸エチル	0.1
水酸化ナトリウム	0.1
トリクロサン	0.2
フッ化第1スズ	0.4
香料	1.0
水	残

計 100.0%

## 【0022】〔実施例3〕練歯磨

沈降性シリカ	25.0%
ゲル化性シリカ	2.0
ソルビット	20.0
プロピレングリコール	2.5
カルボキシメチルセルロースナトリウム	1.0
ラウリルジエタノールアマイド	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5
ラウロイルザルコシンナトリウム	0.3
サッカリンナトリウム	0.1
バラオキシ安息香酸エチル	0.1
トリクロサン	0.05
グルコン酸第1スズ	0.3
ゼラチン	0.2
香料	0.8
水	残

計 100.0%

## 【0023】〔実施例4〕口腔用バスタ

セタノール	10.0%
スクワラン	20.0
沈降性シリカ	5.0
ポリオキシエチレン(40モル)硬化ヒマシ油	0.1
ソルビタンモノオレイン酸エステル	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	0.2
グリチルレチン酸	0.1
サッカリンナトリウム	0.6
トリクロサン	0.3

7

8

フッ化第1スズ

0.1

香料

0.6

水

残

計

100.0%

## 【0024】〔実施例5〕口腔用バスタ

流動パラフィン

15.0%

セタノール

10.0

グリセリン

20.0

ソルビタンモノバルミテート

0.6

ポリオキシエチレン(40モル)

5.0

ソルビタンモノステアレート

ラウリル硫酸ナトリウム

0.1

サッカリンナトリウム

0.5

塩化ベンゼトニウム

0.1

トリクロサン

0.2

フッ化第1スズ

0.05

香料

0.5

水

残

計

100.0%

## 【0025】〔実施例6〕マウスウオッシュ

20

ソルビット

10.0%

エタノール

5.0

ポリオキシエチレン(60モル)硬化ヒマシ油

0.1

ショ糖モノバルミテート

0.2

ラウリル硫酸ナトリウム

0.05

サッカリンナトリウム

0.2

水酸化ナトリウム

0.05

トリクロサン

0.05

フッ化第1スズ

0.15

香料

0.6

水

残

計

100.0%

## 【0026】〔実施例7〕口腔用トローチ

乳糖

97.0%

ポリオキシエチレン(60モル)モノステアレート

0.2

ラウリル硫酸ナトリウム

0.05

クロルヘキシジングルコン酸塩

0.02

ステビア抽出物

0.2

水溶性ゼラチン

0.4

トリクロサン

0.2

グルコン酸第1スズ

0.1

香料

0.02

ヒドロキシエチルセルロース

残

計

100.0%

## 【手続補正書】

【提出日】平成3年12月11日

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正内容】

【0017】【実験例】下記に示した組成に基づき試験液を調製し、この試験液2.7mlに $1.0 \times 10^9$  CFU/mlの大腸菌浮遊液を0.3ml添加し、35℃の水浴中で1分間殺菌反応を行なわせた。反応後、試験液をSCDLP培地（日本製薬（株））で希釈し、その一定量をSCDLP寒天平板（日本製薬（株））上で一晚培養し、生存菌数を求め、下記基準でその効果を評価した。結果を表1に示す。

試験液組成

プロピレングリコール	4.0%
D-ソルビット	20.0
トリクロサン	0.05
界面活性剤（表1に示すもの）	0.5
スズ化合物（表1に示すもの）	0.1
PBS（10mM）	残
計	100.0%

## 【手続補正2】

\*

沈降性シリカ	25.0%
ソルビット	25.0
グリセリン	25.0
ポリビニルピロリドン	1.0
ポリアクリル酸ナトリウム	1.0
ラウロイルポリグリセリンエステル	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.0
サッカリンナトリウム	0.2
パラオキシ安息香酸エチル	0.1
水酸化ナトリウム	0.1
トリクロサン	0.2
フッ化第1スズ	0.4
香料	1.0
水	残
計	100.0%

\*【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正内容】

【0021】【実施例2】練歯磨